

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6 : C07D 495/04, A61K 31/505 // (C07D 495/04, 333:00, 239:00)		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 98/06722 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 19. Februar 1998 (19.02.98)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/04139 (22) Internationales Anmeldedatum: 30. Juli 1997 (30.07.97) (30) Prioritätsdaten: 196 32 423.8 12. August 1996 (12.08.96) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, D- 64293 Darmstadt (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ROCHUS, Jonas [DE/DE]; Stormstrasse 7, D-64291 Darmstadt (DE). SCHELLING, Pierre [DE/DE]; Bardenbergweg 17, D-64367 Mühlthal (DE). KLUXEN, Franz-Werner [DE/DE]; Bessunger Strasse 3, D- 64285 Darmstadt (DE). CHRISTADLER, Maria [DE/DE]; Dürerstrasse 10, D-63322 Rödenmark (DE). (74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frank- furter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).			(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>

(54) Title: THIENOPYRIMIDINES

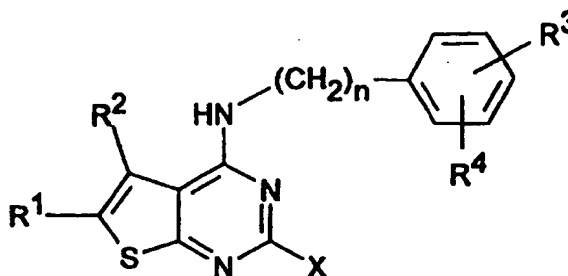
(54) Bezeichnung: THIENOPYRIMIDINE

(57) Abstract

Thienopyrimidines of formula (I) and their physiologically harmless salts, in which R¹, R², R³, R⁴, X and n have the meaning indicated in claim 1, present a phosphodiesterase V-Inhibition activity and can be used in the treatment of cardio-vascular disorders and in impotence therapy.

(57) Zusammenfassung

Thienopyrimidine der Formel (I) sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze, worin R¹, R², R³, R⁴, X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, zeigen eine Phosphodiesterase V-Hemmung und können zur Behandlung von Erkrankungen des Herz-Kreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen eingesetzt werden.



(I)

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

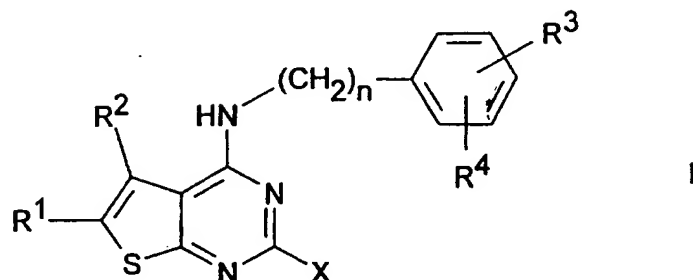
AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland			TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	NZ	Neuseeland		
CM	Kamerun			PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

Thienopyrimidine

Die Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I

5

10



worin

15

R^1, R^2 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Alkenyl, Alkynyl, NO_2 , CF_3 oder Hal, wobei einer der Reste R^1 oder R^2 immer $\neq \text{H}$ ist,

R^1 und R^2 zusammen auch Alkylen mit 3-5 C-Atomen,

20

R^3, R^4 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO_2 , NH_2 , NHA oder NAA',

R^3 und R^4 zusammen auch $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ oder $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

25

A, A' jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen,

30

X einen unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF_3 substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit 1-4 N, O- und/oder S-Atomen, worin zusätzlich weitere CH_2 -Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können, über N oder C gebunden,

35

Hal F, Cl, Br oder I

und

n 0, 1, 2 oder 3

bedeuten,

sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze.

10 Pyrimidinderivate sind beispielsweise aus der EP 201 188 oder der WO 93/06104 bekannt.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit wertvollen Eigenschaften aufzufinden, insbesondere solche, die zur Herstellung von Arzneimitteln verwendet werden können.

Es wurde gefunden, daß die Verbindungen der Formel I und ihre Salze bei guter Verträglichkeit sehr wertvolle pharmakologische Eigenschaften besitzen.

20 Insbesondere zeigen sie eine spezifische Inhibierung der cGMP-Phosphodiesterase (PDE V).

25 Chinazoline mit cGMP-Phosphodiesterase hemmender Aktivität sind z.B. in J. Med. Chem. 36, 3765 (1993) und ibid. 37, 2106 (1994) beschrieben.

Die biologische Aktivität der Verbindungen der Formel I kann nach Methoden bestimmt werden, wie sie z.B. in der WO 93/06104 beschrieben sind.

30 Die Affinität der erfindungsgemäßen Verbindungen für cGMP- und cAMP-Phosphodiesterase wird durch die Ermittlung ihrer IC₅₀-Werte (Konzentration des Inhibitors, die benötigt wird, um eine 50 %ige Inhibierung der Enzymaktivität zu erreichen) bestimmt.

35 Zur Durchführung der Bestimmungen können nach bekannten Methoden isolierte Enzyme verwendet werden (z.B. W.J. Thompson et al., Biochem. 1971, 10, 311). Zur Durchführung der Versuche kann eine modifizierte

"batch"-Methode von W.J. Thompson und M.M. Appleman (Biochem. 1979, 18, 5228) angewendet werden.

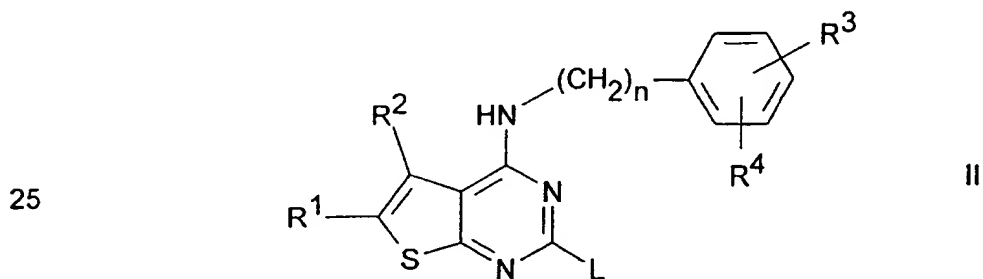
5 Die Verbindungen eignen sich daher zur Behandlung von Erkrankungen des Herz-Kreislaufsystems, insbesondere der Herzinsuffizienz und zur Therapie von Potenzstörungen.

10 Die Verbindungen der Formel I können als Arzneimittelwirkstoffe in der Human- und Veterinärmedizin eingesetzt werden. Ferner können sie als Zwischenprodukte zur Herstellung weiterer Arzneimittelwirkstoffe eingesetzt werden.

15 Gegenstand der Erfindung sind dementsprechend die Verbindungen der Formel I sowie ein Verfahren zur Herstellung

a) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über N gebunden ist,

20 dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II



worin

30 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und n die angegebenen Bedeutungen haben,

und L Cl, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

35 mit einem unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit

mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH₂-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können,

umsetzt,

5

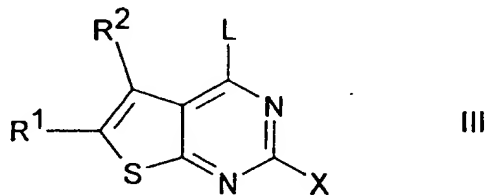
oder

b) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über C gebunden ist,

10

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel III

15



worin

20

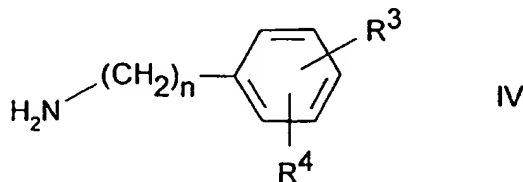
R¹, R² und X die angegebenen Bedeutungen haben,

und L Cl, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

25

mit einer Verbindung der Formel IV

30



worin

R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

35

umsetzt,

oder

5 c) daß man in einer Verbindung der Formel I einen Rest R^1 , R^2 , R^3 und/oder R^4 in einen anderen Rest R^1 , R^2 , R^3 und/oder R^4 umwandelt, indem man eine Nitrogruppe reduziert, eine primäre oder eine sekundäre Aminogruppe durch reduktive Aminierung in ein alkyliertes Amin umwandelt oder acyliert,

10 und/oder daß man eine basische Verbindung der Formel I durch Behandeln mit einer Säure in eines ihrer Salze überführt.

15 Vor- und nachstehend haben die Reste R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X, L und n die bei den Formeln I, II, III, IV und V angegebenen Bedeutungen, sofern nicht ausdrücklich etwas anderes angegeben ist.

15 A und A' bedeuten vorzugsweise jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1-6 C-Atomen.

20 In den vorstehenden Formeln ist Alkyl vorzugsweise unverzweigt und hat 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 C-Atome, vorzugsweise 1, 2, 3, 4 oder 5 C-Atome und bedeutet vorzugsweise Methyl, Ethyl oder Propyl, weiterhin bevorzugt Isopropyl, Butyl, Isobutyl, sek.-Butyl oder tert.-Butyl, aber auch n-Pentyl, neo-Pentyl oder Isopentyl.

25 Alkylen ist vorzugsweise unverzweigt und bedeutet bevorzugt Propylen, Butylen oder Pentylen.

30 Von den Resten R^1 und R^2 steht einer vorzugsweise für H, während der andere bevorzugt Propyl oder Butyl, besonders bevorzugt aber Ethyl oder Methyl bedeutet. Ferner bedeuten R^1 und R^2 auch zusammen bevorzugt Propylen, Butylen oder Pentylen.

Hal bedeutet vorzugsweise F, Cl oder Br, aber auch I.

35

Alkenyl steht vorzugsweise für Vinyl, 1- oder 2-Propenyl, 1-Butenyl, Isobutenyl, sek.-Butenyl, ferner bevorzugt ist 1-Pentenyl, iso-Pentenyl oder 1-Hexenyl.

- 5 Alkynyl steht vorzugsweise für Ethinyl, Propin-1-yl, ferner für Butin-1-, Butin-2-yl, Pentin-1-, Pentin-2- oder Pentin-3-yl.

Die Reste R^3 und R^4 können gleich oder verschieden sein und stehen vorzugsweise in der 3- oder 4-Position des Phenylrings. Sie bedeuten
10 beispielsweise jeweils unabhängig voneinander H, Alkyl, Alkoxy, Nitro, Amino, Alkylamino wie z.B. Methylamino, Dialkylamino wie z.B. Dimethylamino, F, Cl, Br oder I oder zusammen Ethylenoxy, Methylendioxy oder Ethylendioxy. Bevorzugt stehen sie auch jeweils für Alkoxy, wie z.B. für Methoxy, Ethoxy oder Propoxy.

15 Der Rest X ist vorzugsweise unsubstituiertes oder ein-, zwei- oder dreifach durch Alkyl, Hal oder CF_3 substituiertes 2- oder 3-Furyl, 2- oder 3-Thienyl, 1-, 2- oder 3-Pyrrolyl, 1-, 2-, 4- oder 5-Imidazolyl, 2-Methyl-1-imidazol-1-yl, 1-, 3-, 4- oder 5-Pyrazolyl, 2-, 4- oder 5-Oxazolyl, 3-, 4- oder 5-Isoxazolyl,
20 2-, 4- oder 5-Thiazolyl, 3-, 4- oder 5-Isotiazolyl, 2-, 3- oder 4-Pyridyl, 2-, 4-, 5- oder 6-Pyrimidinyl, weiterhin bevorzugt 1,2,3-Triazol-1-, -4- oder -5-yl, 1,2,4-Triazol-1-, -3- oder -5-yl, 1- oder 5-Tetrazolyl, 1,2,3-Oxadiazol-4- oder -5-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3- oder -5-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2- oder -5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3- oder -5-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4- oder -5-yl, 3- oder 4-Pyridazinyl oder Pyrazinyl.

25 Für die gesamte Erfindung gilt, daß sämtliche Reste, die mehrfach auftreten, gleich oder verschieden sein können, d.h. unabhängig voneinander sind.

30 Dementsprechend sind Gegenstand der Erfindung insbesondere diejenigen Verbindungen der Formel I, in denen mindestens einer der genannten Reste eine der vorstehend angegebenen bevorzugten Bedeutungen hat. Einige bevorzugte Gruppen von Verbindungen können durch die folgenden Teilformeln Ia bis Ie ausgedrückt werden, die der Formel I ent-

35

sprechen und worin die nicht näher bezeichneten Reste die bei der Formel I angegebene Bedeutung haben, worin jedoch

5	in Ia	X	Imidazolyl oder Pyridinyl bedeutet;
	in Ib	R^1, R^2	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, NO_2 , CF_3 oder Hal, wobei mindestens einer der Reste R^1 oder R^2 immer $\neq H$ ist,
10		R^3 und R^4	zusammen $-O-CH_2-CH_2-$, $-O-CH_2-O-$ oder $-O-CH_2-CH_2-O$,
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und
		n	1
			bedeuten;
15	in Ic	R^1, R^2	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, NO_2 , CF_3 oder Hal, wobei mindestens einer der Reste R^1 oder R^2 immer $\neq H$ ist,
20		R^3, R^4	jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO_2 , NH_2 , NHA oder NAA',
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und
		n	1
			bedeuten;
25	in Id	R^1 und R^2 R^3 und R^4	zusammen Alkylen mit 3-5 C-Atomen, zusammen $-O-CH_2-CH_2-$, $-O-CH_2-O-$ oder $-O-CH_2-CH_2-O$,
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und
30		n	1
			bedeuten;
35	in Ie	R^1 und R^2 R^3, R^4	zusammen Alkylen mit 3-5 C-Atomen, jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO_2 , NH_2 , NHA oder NAA',
		X	Imidazolyl oder Pyridinyl und

n 1
bedeuten;

5 Die Verbindungen der Formel I und auch die Ausgangsstoffe zu ihrer Herstellung werden im übrigen nach an sich bekannten Methoden hergestellt, wie sie in der Literatur (z.B. in den Standardwerken wie Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart), beschrieben sind, und zwar unter Reaktionsbedingungen, die für die genannten Umsetzungen bekannt und geeignet sind. Dabei kann
10 man auch von an sich bekannten, hier nicht näher erwähnten Varianten Gebrauch machen.

In den Verbindungen der Formeln II, III und IV haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X und n die angegebenen Bedeutungen, insbesondere die angegebenen bevorzugten Bedeutungen.
15

Falls L eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet, so ist diese vorzugsweise Alkylsulfonyloxy mit 1-6 C-Atomen (bevorzugt Methylsulfonyloxy) oder Arylsulfonyloxy mit 6-10 C-Atomen (bevorzugt Phenyl- oder p-Tolylsulfonyloxy, ferner auch 2-Naphthalinsulfonyloxy).
20

Die Ausgangsstoffe können, falls erwünscht, auch in situ gebildet werden, so daß man sie aus dem Reaktionsgemisch nicht isoliert, sondern sofort weiter zu den Verbindungen der Formel I umsetzt.
25 Andererseits ist es möglich, die Reaktion stufenweise durchzuführen.

Die Verbindungen der Formel I, worin X über N an das Thienopyrimidin-Ringsystem gebunden ist, können vorzugsweise erhalten werden, indem man Verbindungen der Formel II mit einem unsubstituierten oder ein-,
30 zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF_3 substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH_2 -Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können, umsetzt.

35

Die Ausgangsstoffe der Formeln II sind teilweise bekannt. Sofern sie nicht bekannt sind, können sie nach an sich bekannten Methoden hergestellt werden.

- 5 Vorstufen der Verbindungen der Formel II können z.B. durch Cyclisierung und Halogenierung analog J. Med. Chem. 24, 374 (1981) hergestellt werden. Durch anschließende Umsetzung mit Arylalkylaminen erhält man die Verbindungen der Formel II.
- 10 Im einzelnen erfolgt die Umsetzung der Verbindungen der Formel II mit dem NH-haltigen Heterocyclus in Gegenwart oder Abwesenheit eines inerten Lösungsmittels bei Temperaturen zwischen etwa -20 und etwa 150°, vorzugsweise zwischen 20 und 100°.
- 15 Der Zusatz eines säurebindenden Mittels, beispielsweise eines Alkali- oder Erdalkalimetall-hydroxids, -carbonats oder -bicarbonats oder eines anderen Salzes einer schwachen Säure der Alkali- oder Erdalkalimetalle, vorzugsweise des Kaliums, Natriums oder Calciums, oder der Zusatz einer organischen Base wie Triethylamin, Dimethylamin, Pyridin oder Chinolin
- 20 oder eines Überschusses der Aminkomponente kann günstig sein.

Als inerte Lösungsmittel eignen sich z.B. Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether, Benzol, Toluol oder Xylol; chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Trichlorethylen, 1,2-Dichlorethan, Tetrachlorkohlenstoff, Chloroform oder

25 Dichlormethan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, n-Propanol, n-Butanol oder tert.-Butanol; Ether wie Diethylether, Diisopropylether, Tetrahydrofuran (THF) oder Dioxan; Glykolether wie Ethylenglykolmono-methyl- oder -monoethylether (Methylglykol oder Ethylglykol), Ethylenglykoldimethylether (Diglyme); Ketone wie Aceton oder Butanon; Amide

30 wie Acetamid, Dimethylacetamid oder Dimethylformamid (DMF); Nitrile wie Acetonitril; Sulfoxide wie Dimethylsulfoxid (DMSO); Nitroverbindungen wie Nitromethan oder Nitrobenzol; Ester wie Ethylacetat oder Gemische der genannten Lösungsmittel.

35

Verbindungen der Formel I, worin X über C an das Thienopyrimidin-Ringsystem gebunden ist, können weiterhin erhalten werden, indem man Verbindungen der Formel III mit Verbindungen der Formel IV umsetzt. Die Ausgangsverbindungen der Formel IV und V sind in der Regel
5 bekannt. Sind sie nicht bekannt, so können sie nach an sich bekannten Methoden hergestellt werden.

Verbindungen der Formel III können z.B. durch Umsetzung mit POCl_3 aus Verbindungen erhalten werden, die aus Thiophenderivaten und CN-substituierten Heterocyclen aufgebaut werden (Eur. J. Med. Chem. 23,
10 453 (1988).

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel III mit Verbindungen der Formel IV erfolgt unter ähnlichen Bedingungen, betreffend die Reaktionszeit, Temperatur und Lösungsmittel, wie dies für die Umsetzung der
15 Verbindungen der Formel II mit den NH-haltigen Heterocyclen beschrieben ist.

Es ist ferner möglich, in einer Verbindung der Formel I einen Rest R^3 und/oder R^4 in einen anderen Rest R^3 und/oder R^4 umzuwandeln, z.B.
20 indem man Nitrogruppen (beispielsweise durch Hydrierung an Raney-Nickel oder Pd-Kohle in einem inerten Lösungsmittel wie Methanol oder Ethanol) zu Aminogruppen reduziert oder Cyangruppen zu COOH -Gruppen hydrolysiert.

Ferner kann man freie Aminogruppen in üblicher Weise mit einem
25 Säurechlorid oder -anhydrid acylieren oder mit einem unsubstituierten oder substituierten Alkylhalogenid alkylieren, zweckmäßig in einem inerten Lösungsmittel wie Dichlormethan oder THF und /oder in Gegenwart einer Base wie Triethylamin oder Pyridin bei Temperaturen zwischen -60 und $+30^\circ$.

Eine Base der Formel I kann mit einer Säure in das zugehörige Säureadditionssalz übergeführt werden, beispielsweise durch Umsetzung äquivalenter Mengen der Base und der Säure in einem inerten Lösungsmittel wie Ethanol und anschließendes Eindampfen. Für diese Umsetzung
35 kommen insbesondere Säuren in Frage, die physiologisch unbedenkliche Salze liefern. So können anorganische Säuren verwendet werden, z.B.

- 5 Schwefelsäure, Salpetersäure, Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäuren wie Orthophosphorsäure, Sulfaminsäure, ferner organische Säuren, insbesondere aliphatische, alicyclische, araliphatische, aromatische oder heterocyclische ein- oder mehrbasige Carbon-, Sulfon- oder Schwefelsäuren, z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Pivalinsäure, Diethylessigsäure, Malonsäure, Bernsteinsäure, Pimelinsäure, Fumarsäure, Maleinsäure, Milchsäure, Weinsäure, Äpfelsäure, Citronensäure, Gluconsäure, Ascorbinsäure, Nicotinsäure, Isonicotinsäure, Methan- oder Ethansulfonsäure, Ethandisulfonsäure, 2-Hydroxyethansulfonsäure, Benzolsulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Naphthalin-mono- und Disulfonsäuren, Laurylschwefelsäure. Salze mit physiologisch nicht unbedenklichen Säuren, z.B. Pikrate, können zur Isolierung und /oder Aufreinigung der Verbindungen der Formel I verwendet werden.
- 10
- 15 Andererseits können, falls gewünscht, die freien Basen der Formel I aus ihren Salzen mit Basen (z.B. Natrium- oder Kaliumhydroxid oder -carbonat) in Freiheit gesetzt werden.
- 20 Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung der Verbindungen der Formel I und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung pharmazeutischer Zubereitungen, insbesondere auf nicht-chemischem Wege. Hierbei können sie zusammen mit mindestens einem festen, flüssigen und/oder halbflüssigen Träger- oder Hilfsstoff und gegebenenfalls in Kombination mit einem oder mehreren weiteren Wirkstoffen in eine geeignete Dosierungsform gebracht werden.
- 25
- 30 Gegenstand der Erfindung sind auch Arzneimittel der Formel I und ihre physiologisch unbedenklichen Salze als Phosphodiesterase V-Hemmer.
- Gegenstand der Erfindung sind ferner pharmazeutische Zubereitungen, enthaltend mindestens eine Verbindung der Formel I und/oder eines ihrer physiologisch unbedenklichen Salze.
- 35 Diese Zubereitungen können als Arzneimittel in der Human- oder Veterinärmedizin verwendet werden. Als Trägerstoffe kommen organische

oder anorganische Substanzen in Frage, die sich für die enterale (z.B. orale), parenterale oder topische Applikation eignen und mit den neuen Verbindungen nicht reagieren, beispielsweise Wasser, pflanzliche Öle, Benzylalkohole, Alkylenglykole, Polyethylenglykole, Glycerintriacetat, Gelatine, Kohlehydrate wie Lactose oder Stärke, Magnesiumstearat, Talk, Vaseline. Zur oralen Anwendung dienen insbesondere Tabletten, Pillen, Dragees, Kapseln, Pulver, Granulate, Sirupe, Säfte oder Tropfen, zur rektalen Anwendung Suppositorien, zur parenteralen Anwendung Lösungen, vorzugsweise ölige oder wässrige Lösungen, ferner Suspensionen, Emulsionen oder Implantate, für die topische Anwendung Salben, Cremes oder Puder. Die neuen Verbindungen können auch lyophilisiert und die erhaltenen Lyophilisate z.B. zur Herstellung von Injektionspräparaten verwendet werden. Die angegebenen Zubereitungen können sterilisiert sein und/oder Hilfsstoffe wie Gleit-, Konservierungs-, Stabilisierungs- und/oder Netzmittel, Emulgatoren, Salze zur Beeinflussung des osmotischen Druckes, Puffersubstanzen, Farb-, Geschmacks- und /oder ein oder weitere Wirkstoffe enthalten, z.B. ein oder mehrere Vitamine.

Die Verbindungen der Formel I und ihre physiologisch unbedenklichen Salze können bei der Bekämpfung von Krankheiten, bei denen eine Erhöhung des cGMP(cyclo-Guanosin-monophosphat)-Spiegels zu Entzündungshemmung oder -verhinderung und Muskelentspannung führt, eingesetzt werden. Besondere Verwendung können die erfindungsgemäßen Verbindungen bei der Behandlung von Krankheiten des Herzkreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen finden.

Vor- und nachstehend sind alle Temperaturen in °C angegeben. In den nachfolgenden Beispielen bedeutet "übliche Aufarbeitung": Man gibt, falls erforderlich, Wasser hinzu, stellt, falls erforderlich, je nach Konstitution des Endprodukts auf pH-Werte zwischen 2 und 10 ein, extrahiert mit Ethylacetat oder Dichlormethan, trennt ab, trocknet die organische Phase über Natriumsulfat, dampft ein und reinigt durch Chromatographie an Kieselgel und /oder durch Kristallisation.

Massenspektrometrie (MS): EI (Elektronenstoß-Ionisation) M^+
FAB (Fast Atom Bombardment) $(M+H)^+$

Beispiel 1

5 Eine Lösung von 3,29 g 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin in 80 ml Dichlormethan wird mit 3,02 g 3,4-Methylenedioxybenzylamin ("A") versetzt und nach Zugabe von 1,52 g Triethylamin 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Lösungsmittel wird entfernt und wie üblich aufgearbeitet. Man erhält 3,38 g 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 162°.

10

Analog erhält man durch Umsetzung von "A"

mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

15

2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

20

2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 222°;

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30

mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 148°;

mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

35

2,6-Dichlor-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Chlor-4-methoxy-benzylamin mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-Chlor-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
20
- mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin.
25
- Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dimethoxy-benzylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
30
- mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

10 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

15 mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

25 mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

30 mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin.

35 Analog erhält man durch Umsetzung von Benzylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-Chlor-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 35 Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Fluorbenzylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 2-Chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5
- mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15
- mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20
- mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25
- mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2,6-Dichlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2,5-Dichlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30
- mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35
- mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dichlorbenzylamin

mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-

10 benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

15

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2,6-Dichlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

30 mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

35

- mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 5 Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Nitrobenzylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 25 2-Chlor-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-(3-nitrobenzylamin)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

5 2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylenedioxyphenethylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

10 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

15 2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

25 2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

30 2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

35 2,6-Dichlor-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-
10 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin.

15 Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Ethylendioxybenzylamin
mit 2,4-Dichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 mit 2,4-Dichlor-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

25 mit 2,4-Dichlor-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclopenteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-Chlor-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-5,6-cyclohepteno-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-
35 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-ethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

5 mit 2,4,6-Trichlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,6-Dichlor-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 2,4,5-Trichlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2,5-Dichlor-6-methyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
10 pyrimidin;

mit 2,4-Dichlor-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-nitro-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

15 mit 2,4-Dichlor-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 mit 2,4-Dichlor-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-Chlor-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 2

25 1,67 g 2-Chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin, 1,02 g Imidazol und 2 g Phenol werden 5 Stunden bei 150 °
erhitzt. Nach Abkühlen wird der Rückstand in Dichlormethan gelöst und
wie üblich aufgearbeitet. Man erhält 1,0 g 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-
30 (3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 248-250°.

Analog erhält man durch Umsetzung von Imidazol mit den unter Beispiel 1
erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung
Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen

35

2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 238°;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 218°;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 260°;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 210°;

2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, Methansulfonat, F. 201°;

2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 245°

2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-
amino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-
amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzyl-
amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 35 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F.
207°;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 197°;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 199°;

2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluor-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 10 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Imidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Imidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(Imidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 2-(Imidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von Pyrazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen

10

2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15

2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 210°;

2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20

2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30

2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylendioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 35 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin; —
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxy-
phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethyl
amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(Pyrazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(Pyrazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(Pyrazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(Pyrazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(Pyrazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(Pyrazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 1,2,4-Triazol mit den unter Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzo-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxy-
phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxy-
phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxy-
benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzyl-
amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 20 Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Methylimidazol mit den unter
Beispiel 1 erhaltenen 2-Chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin-Derivaten, die in 4-
Stellung Arylalkylamino-substituiert sind, die nachstehenden Verbindungen
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzyl-
amino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxy-
benzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, amorph;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxy-
benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxy-
benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methyl-1-yl)-6-nitro-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(4-fluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(4-fluorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3-nitrobenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-methylenedioxy-phenethylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-cyclohepteno-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-ethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-chlor-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5-chlor-6-methyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-nitro-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 2-(2-Methylimidazol-1-yl)-6-trifluormethyl-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 3

- 30 5 g 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen wird mit 2,7 g 3-Cyanpyridin in 40 ml Dioxan gelöst. Anschließend wird für 5 Stunden gasförmiges HCl durch die Lösung geleitet. Nach üblicher Aufarbeitung erhält man 6 g 3,4-Dihydro-4-oxo-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 35

Der Ersatz der Ketogruppe durch Cl unter Ausbildung des aromatischen Pyrimidinrings erfolgt unter Standardbedingungen.

5 Eine Mischung aus 18 ml POCl_3 mit 6 g 3,4-Dihydro-4-oxo-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin unter Zusatz von 1,8 ml N,N-Dimethylanilin wird 4 Stunden gekocht. Nach üblicher Aufarbeitung erhält man 5 g 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

10 Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Cyanpyridin und anschließender Reaktion mit POCl_3

aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothiено-[2,3-d]-pyrimidin, F. 143° ;

aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
20 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen
35 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

5

Analog erhält man durch Umsetzung von 5-Cyanisoxazol und anschließender Reaktion mit POCl_3

aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

10

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15

aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen

20

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25

aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30

aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen

35

4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Cyanpyrazin und
anschließender Reaktion mit POCl₃

10 aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
30 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 2-Cyanpyridin und
anschließender Reaktion mit POCl_3

10 aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
25 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen

- 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 10 Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Cyanpyridin und
anschließender Reaktion mit POCl_3
- aus 2-Amino-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 aus 2-Amino-4-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- aus 2-Amino-4,5,6,7-tetrahydro-3-ethoxycarbonyl-benzothiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
20 pyrimidin;
- aus 2-Amino-4,5-cyclopenteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 aus 2-Amino-4,5-cyclohepteno-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- aus 2-Amino-5-ethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 aus 2-Amino-5-chlor-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- aus 2-Amino-4-chlor-5-methyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
35 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-nitro-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 aus 2-Amino-4,5-dimethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

aus 2-Amino-5-trifluormethyl-3-ethoxycarbonyl-thiophen
4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

10 Beispiel 4

Analog Beispiel 1 erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylenedioxybenzylamin

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 215°;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-
hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclo-
penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclo-
hepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
10
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
35
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
40
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
45

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 185°;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 25 Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Chlor-4-methoxy-benzylamin
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-
hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclo-
penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclo-
hepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-
hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
20 [2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
30 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
35 [2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
- 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
35 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-chlor-4-methoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dimethoxy-benzylamin

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
15 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetra-hydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
35 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
15 pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
30 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-
35 d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- Analog erhält man durch Umsetzung von Benzylamin
15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
20 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
25 2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin, F. 189°;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25 2-(Pyridin-2-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
35

2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-benzylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 4-Fluorbenzylamin

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
35
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-(Pyridin-2-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
35

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(4-fluorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin.

5 Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Dichlorbenzylamin

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

10

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

35

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
25 pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-
35 [2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isioxazol-5-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
20 [2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
35 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
10
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
35
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-dichlorbenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3-Nitrobenzylamin

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(isoxazol-5-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
5 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
10 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
15 d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
20 d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
25 pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30 2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-
35 pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3-nitrobenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin.
- 25 Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Methylendioxyphenethylamin
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylendioxyphenethylamino)-5-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-
trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-
hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclo-
penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-chlor-6-
methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-
trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-methyl-
20 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetra-
hydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclo-
penteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

35

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-methylenedioxyphenethylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Analog erhält man durch Umsetzung von 3,4-Ethylendioxybenzylamin

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

5 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

10 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
 [2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin

15 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
 [1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

20 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

30 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

35 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin

2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

25 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;

35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-methyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
15 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-
[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclopenteno-
20 thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5,6-cyclohepteno-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
25
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-ethyl-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-6-chlor-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
35 2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylendioxybenzylamino)-5-chlor-6-methyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-nitro-thieno-[2,3-
d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-5,6-dimethyl-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-(3,4-ethylenedioxybenzylamino)-6-trifluormethyl-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin.
- Analog erhält man durch Umsetzung von Phenethylamin
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
20 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
25 2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyridin-3-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-3-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-
benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

- 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
20
- mit 4-Chlor-2-(isoxazol-5-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Isoxazol-5-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
35

- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 5 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
10 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 15 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
20 2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 25 mit 4-Chlor-2-(pyrazin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyrazin-2-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 30 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;
5
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 10 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
15 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 20 mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
25 2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
30
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-2-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-2-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 35 mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 5
mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-
pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin;
- 10
mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclopenteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 15
mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-cyclohepteno-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
20
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-ethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-chlor-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- 25
mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5-chlor-6-methyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
30
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-nitro-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;
- mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin
2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-5,6-dimethyl-thieno-[2,3-d]-
pyrimidin;
- 35
mit 4-Chlor-2-(pyridin-4-yl)-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin

2-(Pyridin-4-yl)-4-phenethylamino-6-trifluormethyl-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

Beispiel 5

5

Eine Lösung von 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-nitrobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin in Methanol wird in Gegenwart von Raney-Nickel hydriert. Der Katalysator wird abfiltriert und die Lösung eingeeengt. Man erhält nach Umkristallisation 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-aminobenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

10

Beispiel 6

Eine Lösung von 6 g 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-amino-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin und 0,5 g Titan-tetrachlorid in 100 ml Methanol wird mit 1 ml frisch destilliertem Acetaldehyd versetzt. Anschließend gibt man 4 g Natriumcyanborhydrid dazu und rührt 30 Stunden. Man gibt halbkonzentrierte Salzsäure dazu, arbeitet wie üblich auf und erhält 2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3-N-ethylamino-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin.

15

20

Beispiel 7

Analog Beispiel 2 erhält man die nachstehenden Verbindungen

25

2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-(3,4-difluorbenzylamino)-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 212°;

30

2-(Imidazol-1-yl)-5,6-cyclopenteno-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 221°;

2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-benzylamino-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 241°;

35

2-(Imidazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-dimethoxybenzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 217°;

2-(Imidazol-1-yl)-6-chlor-5-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 250°;

5 2-(Imidazol-1-yl)-5,6,7,8-tetrahydro-4-benzylamino--[1]-benzothieno-
[2,3-d]-pyrimidin, F. 190°;

10 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 231°;

15 2-(Imidazol-1-yl)-6-isopropyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-
thieno-[2,3-d]-pyrimidin, F. 192°;

20 2-(Imidazol-1-yl)-6-propyl-4-(3,4-methylenedioxybenzylamino)-thieno-
[2,3-d]-pyrimidin, F. 183°.

25

30

35

Die nachfolgenden Beispiele betreffen pharmazeutische Zubereitungen:

Beispiel A: Injektionsgläser

5

Eine Lösung von 100 g eines Wirkstoffes der Formel I und 5 g Dinatriumhydrogenphosphat wird in 3 l zweifach destilliertem Wasser mit 2 n Salzsäure auf pH 6,5 eingestellt, steril filtriert, in Injektionsgläser abgefüllt, unter sterilen Bedingungen lyophilisiert und steril verschlossen. Jedes Injektionsglas enthält 5 mg Wirkstoff.

10

Beispiel B: Suppositorien

Man schmilzt ein Gemisch von 20 g eines Wirkstoffes der Formel I mit 100 g Sojalecithin und 1400 g Kakaobutter, gießt in Formen und läßt erkalten. Jedes Suppositorium enthält 20 mg Wirkstoff.

15

Beispiel C: Lösung

Man bereitet eine Lösung aus 1 g eines Wirkstoffes der Formel I, 9,38 g $\text{NaH}_2\text{PO}_4 \cdot 2 \text{H}_2\text{O}$, 28,48 g $\text{Na}_2\text{HPO}_4 \cdot 12 \text{H}_2\text{O}$ und 0,1 g Benzalkoniumchlorid in 940 ml zweifach destilliertem Wasser. Man stellt auf pH 6,8 ein, füllt auf 1 l auf und sterilisiert durch Bestrahlung. Diese Lösung kann in Form von Augentropfen verwendet werden.

20

25

Beispiel D: Salbe

Man mischt 500 mg eines Wirkstoffes der Formel I mit 99,5 g Vaseline unter aseptischen Bedingungen.

30

Beispiel E: Tabletten

Ein Gemisch von 1 kg Wirkstoff der Formel I, 4 kg Lactose, 1,2 kg Kartoffelstärke, 0,2 kg Talk und 0,1 kg Magnesiumstearat wird in üblicher Weise zu Tabletten verpreßt, derart, daß jede Tablette 10 mg Wirkstoff enthält.

35

Beispiel F: Dragees

- 5 Analog Beispiel E werden Tabletten gepreßt, die anschließend in üblicher Weise mit einem Überzug aus Saccharose, Kartoffelstärke, Talk, Tragant und Farbstoff überzogen werden.

Beispiel G: Kapseln

- 10 2 kg Wirkstoff der Formel I werden in üblicher Weise in Hartgelatine-kapseln gefüllt, so daß jede Kapsel 20 mg des Wirkstoffs enthält.

Beispiel H: Ampullen

- 15 Eine Lösung von 1 kg Wirkstoff der Formel I in 60 l zweifach destilliertem Wasser wird steril filtriert, in Ampullen abgefüllt, unter sterilen Bedingungen lyophilisiert und steril verschlossen. Jede Ampulle enthält 10 mg Wirkstoff.

20 **Beispiel I: Inhalations-Spray**

- Man löst 14 g Wirkstoff der Formel I in 10 l isotonischer NaCl-Lösung und füllt die Lösung in handelsübliche Sprühgefäße mit Pump-Mechanismus. Die Lösung kann in Mund oder Nase gesprüht werden. Ein Sprühstoß
25 (etwa 0,1 ml) entspricht einer Dosis von etwa 0,14 mg.

30

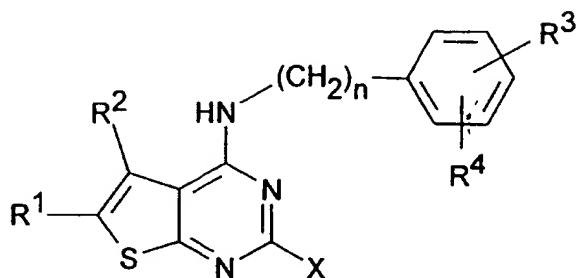
35

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel I

5

10



worin

15

R^1, R^2 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Alkenyl, Alkynyl, NO_2 , CF_3 oder Hal, wobei einer der Reste R^1 oder R^2 immer $\neq \text{H}$ ist,

R^1 und R^2 zusammen auch Alkylen mit 3-5 C-Atomen,

20

R^3, R^4 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal, NO_2 , NH_2 , NHA oder NAA',

R^3 und R^4 zusammen auch $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ oder $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$,

25

A, A' jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen,

30

X einen unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF_3 substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit 1-4 N, O- und/oder S-Atomen, worin zusätzlich weitere CH_2 -Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können, über N oder C gebunden,

35

Hal F, Cl, Br oder I

und

n 0, 1, 2 oder 3

bedeuten,

sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1

(a) 2-(1-Imidazolyl)-6-methyl-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(b) 2-(1-Imidazolyl)-5,6-dimethyl-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(c) 2-(1-Imidazolyl)-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(d) 2-(1-Imidazolyl)-5-chlor-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(e) 2-(1-Imidazolyl)-6-chlor-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-thieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(f) 2-(1,2,4-Triazol-1-yl)-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

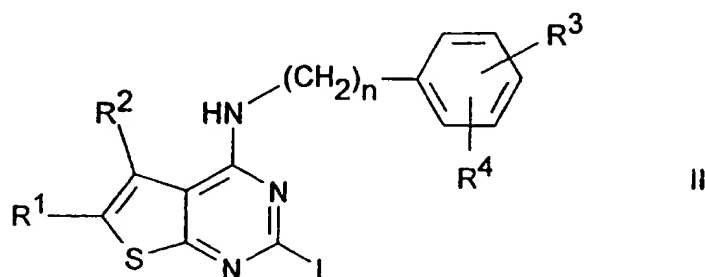
(g) 2-(Pyrazol-1-yl)-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin;

(h) 2-(Pyridin-3-yl)-4-(3,4-methylenedioxy-benzylamino)-5,6,7,8-tetrahydro-[1]-benzothieno-[2,3-d]-pyrimidin.

3. Verfahren zur Herstellung

a) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über N gebunden ist,

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel II



worin

R¹, R², R³, R⁴ und n die angegebenen Bedeutungen haben,

und L Cl, Br, OH, SCH₃ oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

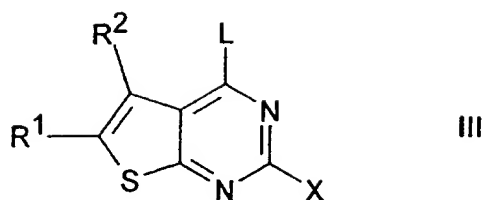
mit einem unsubstituierten oder ein-, zwei- oder dreifach durch A, Hal oder CF₃ substituierten ungesättigten 5-7-gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einer NH-Gruppe, worin zusätzlich weitere CH₂-Gruppen durch NH, NA, S oder O ersetzt sein können,

umsetzt,

oder

b) von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 sowie deren Salzen, worin X über C gebunden ist,

dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel III



5

worin

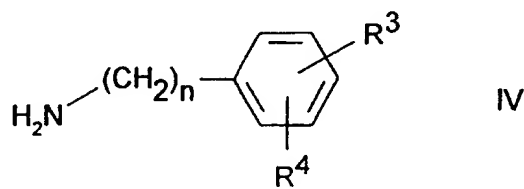
R^1 , R^2 und X die angegebenen Bedeutungen haben,

10

und L Cl, Br, OH, SCH_3 oder eine reaktionsfähige veresterte OH-Gruppe bedeutet,

mit einer Verbindung der Formel IV

15



worin

20

R^3 , R^4 und n die angegebenen Bedeutungen haben,

umsetzt,

25

oder

30

- c) daß man in einer Verbindung der Formel I einen Rest R^1 , R^2 , R^3 und/oder R^4 in einen anderen Rest R^1 , R^2 , R^3 und/oder R^4 umwandelt, indem man eine Nitrogruppe reduziert, eine primäre oder eine sekundäre Aminogruppe durch reduktive Aminierung in ein alkyliertes Amin umwandelt oder acyliert,

und/oder daß man eine basische Verbindung der Formel I durch Behandeln mit einer Säure in eines ihrer Salze überführt.

35

- 5 4. Verfahren zur Herstellung pharmazeutischer Zubereitungen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 und/oder eines ihrer physiologischen unbedenklichen Salze zusammen mit mindestens einem festen, flüssigen oder halbflüssigen Träger- oder Hilfsstoff in eine geeignete Dosierungsform bringt.
- 10 5. Pharmazeutische Zubereitung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel I nach Anspruch 1 und/oder einem ihrer physiologisch unbedenklichen Salze.
- 15 6. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und ihre physiologisch unbedenklichen Salze zur Bekämpfung von Krankheiten des Herzkreislaufsystems und zur Therapie von Potenzstörungen .
- 20 7. Arzneimittel der Formel I nach Anspruch 1 und ihre physiologisch unbedenklichen Salze als Phosphodiesterase V-Hemmer.
8. Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und/oder ihre physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels.
- 25 9. Verwendung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1 und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze bei der Bekämpfung von Krankheiten.

25

30

35

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP 97/04139

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D495/04 A61K31/505 //(C07D495/04,333:00,239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 6 C07D A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 579 496 A (ONO) 19 January 1994 see page 17, line 5 - page 18, line 40; claim 1	1,7
P,X	EP 0 728 759 A (ONO) 28 August 1996 see page 33, line 14 - page 34, line 24; claims 1,12; examples 1,2	1,5,7

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

12 January 1998

Date of mailing of the international search report

20/01/1998

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040. Tx. 31 651 epo nl.
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Alfaro Faus, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/04139

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 579496 A	19-01-94	CA 2100626 A	16-01-94
		JP 2657760 B	24-09-97
		JP 6192235 A	12-07-94
		JP 8099962 A	16-04-96
		US 5436233 A	25-07-95
		US 5439895 A	08-08-95
EP 728759 A	28-08-96	JP 8269060 A	15-10-96

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/04139

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D495/04 A61K31/505 //(C07D495/04,333:00,239:00)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 579 496 A (ONO) 19. Januar 1994 siehe Seite 17, Zeile 5 - Seite 18, Zeile 40; Anspruch 1	1,7
P,X	EP 0 728 759 A (ONO) 28. August 1996 siehe Seite 33, Zeile 14 - Seite 34, Zeile 24; Ansprüche 1,12; Beispiele 1,2	1,5,7

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahelegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

12. Januar 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

20/01/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Alfaro Faus, I

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/04139

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 579496 A	19-01-94	CA 2100626 A	16-01-94
		JP 2657760 B	24-09-97
		JP 6192235 A	12-07-94
		JP 8099962 A	16-04-96
		US 5436233 A	25-07-95
		US 5439895 A	08-08-95
<hr/>			
EP 728759 A	28-08-96	JP 8269060 A	15-10-96
<hr/>			